(57) Zusammenfassung

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :		(11) Internationale Ver ffentlichungsnummer: WO 97/22346
A61K 31/70	A2	(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 26. Juni 1997 (26.06.97)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP		CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL
(22) Internationales Anmeldedatum: 4. December 1996 (		0) 11, 32).
(30) Prioritätsdaten: 195 47 160.1 16. December 1995 (16.12.5	95) I	Veröffentlicht  Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US):  DORF AG [DE/DE]; Unnastrasse 48, D-20245 (DE).	BEIER Hambi	S- ing
(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BÜNGER, [DE/DE]; Niendorfer Kirchenweg 39b, D-22459 (DE). SCHNEIDER, Günther [DE/DE]; Wran 65a, D-20253 Hamburg (DE). SCHREIBER, Jörg Erlenkamp 20, D-22087 Hamburg (DE). TEIC Stefan [DE/DE]; Giesestrasse 67, D-22607 Hamb WOLF, Florian [DE/DE]; Husumer Strasse 2, Hamburg (DE).  (74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnas D-20245 Hamburg (DE).	Hambi gelstra: [DE/D] HMAN urg (D D-202	erg esse E]; fN, E).
		1
(54) Title: USE OF SUGAR DERIVATIVES AS ANTIM	11CRO	BIAL, ANTIMYCOTIC AND/OR ANTIVIRAL ACTIVE SUBSTANCE
(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON ZUCKERDE TIVIRALE WIRKSTOFFE	ERIVA	TEN ALS ANTIMIKROBIELL, ANTIMYKOTISCH UND/ODER AN
(57) Abstract		
Use of alkylated and/or acylated monosaccharides substances.	and/	or oligosaccharides as antimicrobial, antimycotic and/or antiviral activ

Verwendung alkylierter und/oder acylierter Monosaccharide und/oder Oligosaccharide als antimikrobielle, antimykotische und/oder antivirale Wirkstoffe.

#### LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
AT	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
AU	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
вв	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BF	Burkina Faso	ΙE	Irland	PL	Polen
ВG	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
вј	Benin	JР	Japan	RO	Rumänien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CH	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	ТJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauretanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Malawi		

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

#### Beschreibung

Verwendung von Zuckerderivaten als antimikrobiell, antimykotisch und/oder antivirale Wirkstoffe

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung an sich bekannter Substanzen als gegen Bakterien, Mycota und Viren wirksame Substanzen. In besonderen Ausführungsformen betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische und dermatologische Zubereitungen, solche Substanzen enthaltend.

Der gesunde warmblütige Organismus, insbesondere die gesunde menschliche Haut, ist mit einer Vielzahl nichtpathogener Mikroorganismen besiedelt. Diese sogenannte Mikroflora der Haut ist nicht nur unschädlich, sie stellt einen wichtigen Schutz zur Abwehr opportunistischer oder pathogener Keime dar.

Bakterien gehören zu den prokaryotischen Einzellern. Sie können grob nach ihrer Form (Kugel, Zylinder, gekrümmter Zylinder) sowie nach dem Aufbau ihrer Zellwand (grampositiv, gramnegativ) unterschieden werden. Feinere Unterteilungen tragen auch der Physiologie der Organismen Rechnung. So existieren aerobe, anaerobe sowie fakultativ anaerobe Bakterien. Manche Individuen sind in ihrer Eigenschaft als pathogene Keime von medizinischer Bedeutung, andere wiederum sind vollkommen harmlos.

Gegen Bakterien wirksame Substanzen sind seit geraumer Zeit bekannt. Der Begriff "Antibiotika" beispielsweise, der nicht auf alle antimikrobiell wirksamen Substanzen anwendbar ist, läßt sich auf das Jahr 1941 datieren, obwohl die ersten Erkenntnisse zum Penicillin bereits im Jahre 1929 gefunden wurden. Antibiotika im heutigen Sinne sind nicht für alle medizinischen, schon gar nicht kosmetische Anwendungen geeignet, da häufig auch der warmblütige Organismus, also etwa der erkrankte Patient, bei Anwendung auf irgendeine Weise in seinen Stoffwechselfunktionen beeinträchtigt wird.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war also, den Stand der Technik in dieser Richtung zu bereichern, insbesondere also, Substanzen zur Verfügung zu stellen, welche gegen grampositive und/oder gramnegative Bakterien wirksam sind, ohne daß mit der Anwendung der Substanzen eine unvertretbare Beeinträchtigung der Gesundheit des Anwenders verbunden wäre.

Gramnegative Keime sind beispielsweise Escherichia coli, Pseudomonas-Arten sowie Enterobacteriaceen, wie etwa Citrobacter freundii.

Auch grampositive Keime spielen in Kosmetik und Dermatologie eine Rolle. Bei der unreinen Haut beispielsweise sind neben anderen Einflüssen bakterielle Sekundärinfektionen von ätiologischer Bedeutung. Einer der wichtigsten Mikroorganismen, der in Zusammenhang mit unreiner Haut steht, ist Propionibacterium acnes.

Unreine Haut und/oder Komedonen beeinträchtigen das Wohlbefinden der Betroffenen aber selbst in leichten Fällen. Da praktisch jeder oder jede Jugendliche von unreiner Haut irgendeiner Ausprägung betroffen ist, besteht bei vielen Personen Bedarf, diesem Zustande abzuhelfen.

Eine besondere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, einen gegen unreine Haut bzw. Propionibacterium acnes wirksamen Stoff bzw. Stoffkombination zu finden.

Die vorliegende Erfindung betrifft in einer weiteren Ausführungsform kosmetische Desodorantien. Solche Formulierungen dienen dazu, Körpergeruch zu beseitigen, der entsteht, wenn der an sich geruchlose frische Schweiß durch Mikroorganismen zersetzt wird. Den üblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosolsprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise D o-Stifte ("Sticks"), Puder, Pudersprays, Intimreinigungsmittel usw.

In sogenannten Antitranspirantien kann durch Adstring ntien - vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid (Aluchlorhydrat) - die Entstehung des Schweißes unterbunden werden. Abgesehen von der Denaturierung der Hautproteine greifen die dafür verwendeten Stoffe aber, abhängig von ihrer Dosierung, drastisch in den Wärmehaushalt des Achselbereiches ein und sollten allenfalls in Ausnahmefällen angewandt werden.

Durch die Verwendung antimikrobieller Stoffe in kosmetischen Desodorantien kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen wirksam reduziert werden. In der Praxis hat sich aber herausgestellt, daß die gesamte Mikroflora der Haut beeinträchtigt werden kann. Der Schweißfluß selbst wird dadurch nicht beeinflußt, im Idealfalle wird nur die mikrobielle Zersetzung des Schweißes zeitweilig gestoppt.

Auch die Kombination von Adstringentien mit antimikrobiell wirksamen Stoffen in ein und derselben Zusammensetzung ist gebräuchlich. Die Nachteile beider Wirkstoffklassen lassen sich auf diesem Wege jedoch nicht vollständig beseitigen.

Schließlich kann Körpergeruch auch durch Duftstoffe überdeckt werden, eine Methode, die am wenigsten den ästhetischen Bedürfnissen des Verbrauchers gerecht wird, da die Mischung aus Körpergeruch und Parfümduft eher unangenehm riecht.

Allerdings werden die meisten kosmetischen Desodorantien, wie auch die meisten Kosmetika insgesamt, parfümiert, selbst wenn sie desodorierende Wirkstoffe beinhalten. Parfümierung kann auch dazu dienen, die Verbraucherakzeptanz eines kosmetischen Produktes zu erhöhen oder einem Produkt ein bestimmtes Flair zu geben.

Die Parfümierung wirkstoffhaltiger kosmetischer Mittel, insbesondere kosmetischer Desodorantien, ist allerdings nicht selten problematisch, weil Wirkstoffe und Parfümbestandteile gelegentlich miteinander reagieren und einander unwirksam machen könn n.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

4

- 1) Sie sollen eine zuverlässige Desodorierung bewirken.
- Die natürlichen biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht durch die Desodorantien beeinträchtigt werden.
- Die Desodorantien müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 5) Sie sollen sich gut in übliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

Eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen. Insbesondere sollten die Desodorantien die Mikroflora der Haut weitgehend schonen, die Zahl der Mikroorganismen aber, die für den Körpergeruch verantwortlich sind, selektiv reduzieren.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen. Auf keinen Fall sollten die desodorierenden Wirkprinzipien sich auf der Haut anreichern.

Eine weitere Aufgabe war, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, welche mit einer möglichst großen Vielzahl an üblichen kosmetischen Hilfs- und Zusatzstoffen harmonieren, insbesondere mit den gerade in desodorierend oder antitranspirierend wirkenden Formulierungen bedeutenden Parfümbestandteilen.

Noch eine weitere Aufgabe der Erfindung war, kosmetische Desodorantien zur Verfügung zu stellen, welche über einen längeren Zeitraum, und zwar in der Größenordnung von mindestens einem halben Tag, wirksam sind, ohne daß ihre Wirkung spürbar nachläßt.

Schließlich war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, desodorierende kosmetische Prinzipien zu entwickeln, die möglichst universell in die verschiedensten Darreichungsformen kosmetischer Desodorantien eingearbeitet werden können, ohne auf eine oder wenige spezielle Darreichungsformen festgelegt zu sein.

Pilze, auch Fungi [fungus = lat. Pilz], Mycota [ $\mu\nu\kappa\eta\zeta$  = grch. Pilz] oder Mycobionten genannt, zählen im Gegensatze zu den Bakterien zu den Eucaryonten. Eucaryonten

. 124

sind Lebewesen, deren Zellen (Eucyten) im Gegensatz zu denen der sogenannten Procaryonten (Procyten) über einen durch Kernhülle und Kernmembran vom restlichen Cytoplasma abgegrenzten Zellkern verfügen. Der Zellkern enthält die Erbinformation in Chromosomen gespeichert.

Zu Vertretern der Mycobionten zählen beispielsweise Hefen (Protoascomycetes), Schimmelpilze (Plectomycetes), Mehltau (Pyrenomycetes), der falsche Mehltau (Phycomycetes) und die Ständerpilze (Basidiomycetes).

Pilze, auch nicht die Basidiomyceten, sind keine pflanzlichen Organismen, haben aber wie diese eine Zellwand, zellsaftgefüllte Vakuolen und eine mikroskopisch gut sichtbare Plasmaströmung. Sie enthalten keine photosynthetischen Pigmente und sind C-heterotroph. Sie wachsen unter aeroben Bedingungen und gewinnen Energie durch Oxidation organischer Substanzen. Einige Vertreter, beispielsweise Hefen, sind allerdings fakultative Anaerobier und zur Energiegewinnung durch Gärungsprozesse befähigt.

Dermatomycosen sind Krankheiten, bei der gewisse Pilzarten, insbesondere Dermatophyten, in die Haut und Haarfollikel eindringen. Die Symptome von Dermatomycosen sind beispielsweise Bläschen, Exfoliation, Rhagaden und Erosion, meist verbunden mit Juckreiz oder allergischem Ekzem.

Dermatomycosen können im wesentlichen in folgende vier Gruppen unterteilt werden: Dermatophytien (z.B. Epidermophytie, Favus, Mikrosporie, Trichophytie), Hefemycosen (z.B. Pityriasis und andere Pityrosporum-bedingte Mycosen, Candida-Infektionen, Blastomycose, Busse-Buschke-Krankheit, Torulose, Piedra alba, Torulopsidose, Trichosporose), Schimmelmycosen (z.B. Aspergillose, Kephalosporidose, Phycomycose und Skopulariopsidose), Systemmycosen (z.B. Chromomycose, Coccidiomycose, Histoplasmose).

Zu den pathogenen und fakultativ pathogenen Keimen gehören beispielsweise aus der Gruppe der Hefen Candida-Arten (z.B. Candida albicans) und solche der Familie Pityrosporum. Pityrosporum-Arten, insbesondere Pityrosporum ovale, sind für Hauter-krankungen wie Pityriasis versicolor, Seborrhoe in den Formen Seborrhoea oleosa und Seborrhoea sicca, welche sich vor allem als Seborrhoea capitis (=

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

6

Kopfschuppen) äußern, seborrhoisches Ekzem und Pityrosporum-Follikulitis verantwortlich zu machen. Eine Beteiligung von Pityrosporum ovale an der Entstehung von Psoriasis wird von der Fachwelt diskutiert.

Alle Bereiche der menschlichen Haut können von Dermatomycosen befallen werden. Dermatophytien befallen fast ausschließlich Haut, Haare und Nägel. Hefemycosen können auch Schleimhäute und innere Organe befallen, Systemmycosen erstrecken sich regelmäßig auf ganze Organsysteme.

Besonders häufig sind die Körperbereiche betroffen, auf welchen sich durch Kleidung, Schmuck oder Schuhwerk Feuchtigkeit und Wärme stauen können. So gehört der Fußpilz zu den bekanntesten und am weitesten verbreiteten Dermatomycosen. Besonders unangenehm sind weiterhin Pilzerkrankungen der Finger- und Fußnägelbereiche (Onychomycosen).

Ferner sind Superinfektionen der Haut durch Pilze und Bakterien nicht selten.

Bei bestehendem Primärinfekt, d.h., der normalen Keimbesiedelung der Haut, eintretende Neuinfektion mit hohen Keimzahlen eines oder mehrerer oft physiologischer Erreger, beispielsweise Staphylokokken, oft aber auch unphysiologischer Erreger, beispielsweise Candida albicans, kann bei Zusammentreffen ungünstiger Einflüssen eine "Superinfektion" der befallenen Haut auftreten. Die normale Mikroflora der Haut (oder eines anderen Körperorgans) wird dabei von dem Sekundärerreger regelrecht überwuchert.

Solche Superinfektionen können sich, in Abhängigkeit vom betreffenden Keim, in günstig verlaufenden Fällen in unangenehmen Hauterscheinungen (Juckreiz, unschönes äußeres Erscheinungsbild) äußern. In ungünstig verlaufenden Fällen können sie aber zu großflächiger Zerstörung der Haut führen, im schlimmsten Falle sogar im Tode des Patienten gipfeln.

Superinfektionen der vorab geschilderten Art sind z.B. beim Vollbild von AIDS häufig auftretende Sekundärerkrankungen. An sich - jedenfalls in geringen K imdicht n -unschädliche, aber unter Umständen auch ausgesprochen pathog ne Keime überwu-

7

chern auf diese Weise die gesunde Hautflora. Bei AIDS allerdings sind auch andere Körperorgane von Superinfektionen betroffen.

Ebenso werden derartige Superinfektionen bei einer Vielzahl dermatologischer Erkrankungen, z.B. atopischem Ekzem, Neurodermitis, Akne, seborrhoischer Dermatitis oder Psoriasis beobachtet. Auch viele medizinische und therapeutische Maßnahmen, z.B die Radio- oder Chemotherapie von Tumorerkrankungen, als Nebenwirkung hervorgerufene, medikamentös induzierte Immunsuppression oder aber systemische Antibiotikabehandlung, ebenso wie externe chemische oder physikalische Einflüsse (z.B. Umweltverschmutzung, Smog, extreme UV-Lichtexposition), fördern das Auftreten von Superinfektionen der äußeren und inneren Organe, insbesondere der Haut und der Schleimhäute.

Zwar ist es im Einzelfalle ohne weiteres möglich, Superinfektionen mit Antibiotika zu bekämpfen, meistens haben solche Substanzen aber den Nachteil unangenehmer Nebenwirkungen. Oft sind Patienten beispielsweise gegen Penicilline allergisch, weswegen eine entsprechende Behandlung sich in einem solchen Falle verbieten würde.

Ferner haben topisch verabreichte Antibiotika den Nachteil, daß sie die Hautflora nicht nur vom Sekundärerreger befreien, sondern auch die an sich physiologische Hautflora stark beeinträchtigen und der natürliche Heilungsprozeß auf diese Weise wieder gebremst wird.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war, die Nachteile des Standes der Technik zu beseitigen und Substanzen und Zubereitungen, solche Substanzen enthaltend, zur Verfügung zu stellen, durch deren Verwendung Superinfektionen geheilt werden können, wobei die physiologische Hautflora keine nenneswerte Einbußen erleidet.

Im Gegensatze zu den prokaryotischen und eukaryotischen zellulären Organismen sind Viren [virus = lat. Gift] biologische Strukturen, welche zur Biosynthese eine Wirtszelle benötigen. Extrazelluläre Viren (auch "Virionen" genannt) bestehen aus einer ein- oder doppelsträngigen Nukleinsäuresequenz (DNS oder RNS) und einem Proteinmantel (dapsid genannt), gegebenenfalls einer zusätzlichen lipidhaltigen Hülle (Envelope) umgeben. Die Gesamtheit aus Nukleinsäure und Capsid wird auch Nucleocapsid genannt. Die Klassifikation der Vir n erfolgte klassisch nach klinischen

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

8

Kriterien, heutzutage allerdings zumeist nach ihrer Struktur, ihrer Morphologie, insbesondere aber nach der Nukleinsäuresequenz.

Medizinisch wichtige Virengattungen sind beispielsweise Influenzaviren (Familie der Orthomyxoviridae), Lyssaviren (z.B. Tollwut, Familie der Rhabdoviren) Enteroviren (z.B. Hepatitis-A, Familie der Picornaviridae), Hepadnaviren (z.B. Hepatitis-B, Familie der Hepadnaviridae).

Viruzide, also Viren abtötende Substanzen im eigentlichen Sinne gibt es nicht, da Viren nicht über eigenen Stoffwechsel verfügen. Es wurde aus diesem Grunde auch diskutiert, ob Viren als Lebewesen eingeordnet werden sollten. Pharmakologische Eingriffe ohne Schädigung der nicht befallenen Zellen ist jedenfalls schwierig. Mögliche Wirkmechanismen im Kampfe gegen die Viren sind in erster Linie die Störung deren Replikation, z.B. durch Blockieren der für die Replikation wichtigen Enzyme, die in der Wirtszelle vorliegen. Ferner kann das Freisetzen der viralen Nukleinsäuren in die Wirtszelle verhindert werden. Im Rahmen der hiermit vorgelegten Offenbarung wird unter Begriffen wie "antiviral" oder "gegen Viren wirksam", "viruzid" oder ähnlichen die Eigenschaft einer Substanz verstanden, einen ein- oder mehrzelligen Organismus vor schädlichen Folgen einer Virusinfektion, sei es prophylaktisch oder therapeutisch, zu schützen, ungeachtet dessen, was der tatsächliche Wirkmechanismus der Substanz im Einzelfalle sei.

Dem Stande der Technik mangelt es jedoch an gegen Viren wirksamen Substanzen, welche zudem den Wirtsorganismus nicht oder nicht in vertretbarem Maße schädigen.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war also, diesem Übelstande abzuhelfen, also Substanzen zu finden, welche wirksam einen ein- oder mehrzelligen Organismus vor schädlichen Folgen einer Virusinfektion, sei es prophylaktisch oder therapeutisch, zu schützen.

Es wurde überraschend gefunden, und darin liegt die Lösung dieser Aufgabe, daß die Verwendung alkylierter und/oder acylierter Monosaccharide und/oder Oligosaccharide als antimikrobiell, antimykotisch und/oder antivirale Wirkstoffe den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

Es hat sich in erstaunlicher Weise herausgestellt, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe das Wachstum von grampositiven und gramnegativen Bakterien, Mycobionten sowie Viren verhindern.

Insbesondere sind die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe befähigt, daß Wachstum von Hefen, insbesondere der Pityrosporum-Arten, namentlich Pityrosporum ovale, zu verhindern.

Es hat sich ferner herausgestellt, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe die Bildung von seborrhoischen Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, verhindern sowie bereits vorhandene seborrhoische Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, zu beseitigen.

Die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe eignen sich darüberhinaus gut für die Verwendung als desodorierender Wirkstoff in kosmetischen Desodorantien sowie gegen unreine Haut, leichte Formen der Akne bzw. Propionibakterium acnes.

Schließlich hat sich herausgestellt, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe den Verderb organischer Substanz, insbesondere kosmetischer und dermatologischer Zubereitungen, durch den Befall mit grampositiven und gramnegativen Bakterien, Mycobionten und Viren verhindern können, wenn sie diesen Zubereitungen zugesetzt werden.

Gelegentlich werden die erfindungsgemäß verwendeten alkylierten und/oder acylierten Monosaccharide und/oder Oligosaccharide auch als Alkyl- bzw. Acyl-Monoglycoside bzw. -Oligoglycoside genannt, da die Alkyl- bzw. Acylgruppe glycosidisch mit der Saccharidgruppe verbunden ist.

Erfindungsgemäß sind somit auch ein Verfahren zur Bekämpfung von Mycobionten, dadurch gekennzeichnet, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen oder dermatologischen Träger, mit dem durch Mycobionten kontaminierten Bereich in Kontakt gebracht werden, sowie ein Verfahren zum Schutze organischer Produkte vor dem Befall mit Mycobionten,

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

10

dadurch gekennzeichnet, daß diesen organischen Produkten die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe in wirksamer Menge zugegeben werden.

Der Stand der Technik lieferte folglich nicht den geringsten Hinweis auf die erfindungsgemäße Verwendung als antimycotisches Wirkprinzip.

Ferner war erstaunlich, daß die die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe besonders gut wirksam sind gegen den für das Entstehen von Kopfschuppen verantwortlichen Keim Pityrosporum ovale und verwandte Keime. Eine bevorzugte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung sind mithin gegen Kopfschuppen anzuwendende Formulierungen, beispielsweise Antischuppenshampoos.

Die erfindungsgemäß verwendeten alkylierten und/oder acylierten Monosaccharide und/oder Oligosaccharide werden bevorzugt von der generischen Struktur Glyc-R umfaßt, wobei Glyc eine Monosaccharid-Gruppe, eine Disaccharid-Gruppe oder eine Trisaccharid-Gruppe umfaßt und der Rest R, welcher eine verzweigte oder unverzweigte gesättigte Alkylgruppe oder Acylgruppe mit 1 - 25 Kohlenstoffatomen umfaßt, welche glycosidisch an die Gruppe Glyc gebunden ist.

Die den erfindungsgemäß verwendeten Alkyl- bzw. Acyl-Monoglycosiden vorteilhaft zugrundeliegenden Hexosen werden bevorzugt gewählt aus der Gruppe der Aldohexosen, gewöhnlich in ihrer pyranosiden Form, also Allo(pyrano)se, Altro(pyrano)se, Gluco(pyrano)se, Manno(pyrano)se, Gulo(pyrano)se, Ido(pyrano)se, Galakto(pyrano)se und Talo(pyrano)se, aber auch die in furanosider Form vorliegenden Aldohexosylderivate sind erfindungsgemäß gegebenenfalls vorteilhaft zu verwenden.

Erfindungsgemäß verwendeten Disacchariden zugrundeliegende (Hexosyl)hexosen sind vorteilhaft und können bevorzugt aus der Gruppe der Pyranosylpyranosen und Furanosylpyranosen mit 1,4-glycosidischer oder 1,6-glycosidischer Bindung gewählt werden. Sie werden bevorzugt gewählt aus der Gruppe Maltose, Leucrose, Lactose, Saccharose.

Entsprechend lassen sich die erfindungsgemäß bevorzugt verwendeten Alkyl- bzw. Acyl-Monoglycoside durch die allgemeinen Strukturformeln

bzw.

und die erfindungsgemäß verwendeten Alkyl- bzw. Acyl-Diglycoside bzw. - Oligoglycoside durch die allgemeinen Strukturformeln

bzw.

bzw.

12

$$H_2C$$
 $OH$ 
 $H_2C$ 
 $OH$ 
 $OH$ 
 $OH$ 
 $OH$ 
 $OH$ 
 $OH$ 
 $OH$ 

mit p = 1 - 4

bzw.

mit q = 1 - 4

kennzeichnen, wobei  $R_1$  -  $R_6$  verzweigte oder unverzweigte gesättigte Alkylgruppen oder Acylgruppen mit 1 - 25 Kohlenstoffatomen umfassen.

D-Glycoside einzusetzen ist von Vorteil, gleichwohl können auch L-Glycoside oder gemischte D/L-Glycoside vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung eingesetzt werden.

Auch Hexosylglycoside, denen D- oder L-Ketohexosen zugrunde liegen, also Psicose, Fructose, Sorbose oder Tagatose, gewöhnlich in ihrer furanosiden Form vorliegend, können gegebenenfalls vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung eingesetzt werden.

Erfindungsgemäß besonders vorteilhaft verwendete Alkyl- bzw. Acylglycoside werden gewählt aus der Gruppe  $\beta$ -D-Octylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Nonylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Decylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Undecylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Dodecylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Tetradecylglucopyranosid und  $\beta$ -D-Hexadecylglucopyranosid.

Besonders bevorzugt sind  $\beta$ -D-Octylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Nonylglucopyranosid und  $\beta$ -D-Dodecylglucopyranosid, welche sich insbesondere durch sehr gute Wirkung gegen Corynebacterium x rosis auszeichnen.

1)

Es ist ebenfalls von Vorteil, natürliche oder synthetische Roh- und Hilfsstoffe bzw. Gemische einzusetzen, welche sich durch einen wirksamen Gehalt an den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffen auszeichnen, beispielsweise Plantaren® 1200 (Hankel KGaA), Oramix® NS 10 (Seppic).

Es hat sich in erstaunlicher Weise herausgestellt, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe das Wachstum von grampositiven und gramnegativen Bakterien, Mycobionten sowie Viren verhindern.

Insbesondere sind die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe befähigt, daß Wachstum von Hefen, insbesondere der Pityrosporum-Arten, namentlich Pityrosporum ovale, zu verhindern.

Es hat sich ferner herausgestellt, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe die Bildung von seborrhoischen Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, verhindern sowie bereits vorhandene seborrhoische Erscheinungen, insbesondere Kopfschuppen, zu beseitigen.

Die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe eignen sich darüberhinaus gut für die Verwendung als desodorierender Wirkstoff in kosmetischen Desodorantien sowie gegen unreine Haut, leichte Formen der Akne bzw. Propionibakterium acnes.

Schließlich hat sich herausgestellt, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe den Verderb organischer Substanz, insbesondere kosmetischer und dermatologischer Zubereitungen, durch den Befall mit grampositiven und gramnegativen Bakterien, Mycobionten und Viren verhindern können, wenn sie diesen Zubereitungen zugesetzt werden.

Erfindungsgemäß sind somit auch ein Verfahren zur Bekämpfung von Mycobionten, dadurch gekennzeichnet, daß die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen oder dermatologischen Träger, mit dem durch Mycobionten kontaminierten Bereich in Kontakt gebracht werden, sowie ein Verfahren zum Schutze organischer Produkte vor dem Befall mit Mycobionten,

dadurch gekennzeichnet, daß diesen organischen Produkten die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe in wirksamer Menge zugegeben werden.

Der Stand der Technik lieferte folglich nicht den geringsten Hinweis auf die erfindungsgemäße Verwendung als antimycotisches Wirkprinzip.

Ferner war erstaunlich, daß die die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe besonders gut wirksam sind gegen den für das Entstehen von Kopfschuppen verantwortlichen Keim Pityrosporum ovale und verwandte Keime. Eine bevorzugte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung sind mithin gegen Kopfschuppen anzuwendende Formulierungen, beispielsweise Antischuppenshampoos.

Erfindungsgemäß werden die Wirkstoffe bevorzugt in kosmetischen oder dermatologischen Zusammensetzungen eingesetzt einem Gehalt von 0,005 - 50,0 Gew.-%, insbesondere 0,01 - 20,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung bevorzugt sind. Vorteilhaft enthalten die Zusammensetzungen 0,02 - 10,0 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,02 - 5,0 Gew.-% an den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffen, ganz besonders vorteilhaft 0,5 - 3,0 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.

Die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe lassen sich ohne Schwierigkeiten in gängige kosmetische oder dermatologische Formulierungen einarbeiten, vorteilhaft in Pumpsprays, Aerosolsprays, Crèmes, Salben, Tinkturen, Lotionen, Nagelpflegeprodukte (z.B. Nagellacke, Nagellackentferner, Nagelbalsame) und dergleichen.

Es ist auch möglich und gegebenenfalls vorteilhaft, die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe mit anderen Wirkstoffen zu kombinieren, beispielsweise mit anderen antimikrobiell, antimycotisch bzw. antiviral wirksamen Stoffen.

Es ist vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen abzupuffern. Vorteilhaft ist ein pH-Bereich von 3,5 - 7,5. Besonders günstig ist es, den pH-Wert in einem Bereich von 4,0 - 6,5 zu wählen.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Formulierungen können wie üblich zusammengesetzt sein und zur Behandlung der Haut und/oder der

Haare im Sinne einer dermatologischen Behandlung oder einer Behandlung im Sinne der pflegenden Kosmetik dienen. Sie können aber auch in Schminkprodukten in der dekorativen Kosmetik eingesetzt werden.

Zur Anwendung werden die erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Formulierungen in der für Kosmetika und Dermatika üblichen Weise auf die Haut und/oder die Haare in ausreichender Menge aufgebracht.

Vorteilhaft sind solche kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorteilhaft enthalten diese zusätzlich mindestens einen UVA-Filter und/oder mindestens einen UVB-Filter und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Kosmetische Zubereitungen gemäß der Erfindung zum Schutze der Haut vor "UV-Strahlen können in verschiedenen Formen vorliegen, wie sie z.B. üblicherweise für diesen Typ von Zubereitungen eingesetzt werden. So können sie z.B. eine Lösung, eine Emulsion vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder vom Typ Öl-in-Wasser (O/W), oder eine multiple Emulsionen, beispielsweise vom Typ Wasser-in-Öl-in-Wasser (W/O/W), ein Gel, eine Hydrodispersion, einen festen Stift oder auch ein Aerosol darstellen.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Antioxidantien, Parfüme, Mittel zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdikkungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende Substanzen, anfeuchtende und/oder feuchhaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung eine Lösung oder Lotion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:

- Wasser oder wäßrige Lösungen;
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

16

- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl, -monoethyl- oder monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α-Carotin, β-Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ-Linoleyl-, Cholesteryl - und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis µmol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z.B. Zitronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B. γ-Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg - Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin E - acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin A - palmitat) sowie Konyferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxytonisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Erfindungsgemäße Emulsionen sind vorteilhaft und enthalten z.B. die genannten Fette, Öle, Wachse und anderen Fettkörper, sowie Wasser und einen Emulgator, wie er üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet wird.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen

vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugweise ein Polyacrylat ist.

Feste Stifte gemäß der Erfindung enthalten z.B. natürliche oder synthetische Wachse, Fettalkohole oder Fettsäureester. Bevorzugt werden Lippenpflegestifte sowie desodorierende Stifte ("Deo-Sticks").

Als Treibmittel für erfindungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische oder dermatologische Zubereitungen sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, z.B. Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die vorliegende Erfindung geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe (FKW) und Fluorchlorkohlenwassertoffe (FCKW).

Bevorzugt können die erfindungsgemäßen Zubereitungen zudem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel dienen.

Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z.B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z.B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure (2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;

- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)est r, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon:
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 2,4,6-Trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin

#### Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z.B. Natrium-, Kaliumoder Triethanolammonium-Salze,
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert.Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

Erfindungsgemäße kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

20

Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Bei kosmetischen Zubereitungen zur Pflege der Haare handelt es sich beispielsweise um Shampoonierungsmittel, Zubereitungen, die beim Spülen der Haare vor oder nach der Shampoonierung, vor oder nach der Dauerwellbehandlung, vor oder nach der Färbung oder Entfärbung der Haare angewendet werden, um Zubereitungen zum Fönen oder Einlegen der Haare, Zubereitungen zum Färben oder Entfärben, um eine Frisier- und Behandlungslotion, einen Haarlack oder um Dauerwellmittel.

Die kosmetischen Zubereitungen enthalten Wirkstoffe und Hilfsstoffe, wie sie üblicherweise für diesen Typ von Zubereitungen zur Haarpflege und Haarbehandlung verwendet werden.

Als Hilfsstoffe dienen Konservierungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Emulgatoren, Verdickungsmittel, Fette, Öle, Wachse, organische Lösungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Farbstoffe oder Pigmente, deren Aufgabe es ist, die Haare oder die Zubereitung selbst zu färben, Elektrolyte, Zubereitungen gegen das Fetten der Haare.

Kosmetische Zubereitungen, die ein Shampoonierungsmittel oder eine Wasch-, Dusch- oder Badezubereitung darstellen, enthalten vorzugsweise mindestens eine anionische, nicht-ionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz oder Gemische daraus, erfindungsgemäße Wirkstoffe und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden.

Beispiele für oberflächen aktive Substanzen, die erfindungsgemäß vorteilhaft verwendet werden können, sind herkömmliche Seifen, z.B. Fettsäuresalze des Natriums, Alkylsulfate, Alkylethersulfate, Alkan- und Alkylbenzolsulfonate, Sulfoacetate, Sulfobetaine, Sarcosinate, Amidosulfobetaine, Sulfosuccinate, Sulfobernsteinsäurehalbester, Alkylethercarboxylate, Eiweiß-Fettsäure-Kondensate, Alkylbetaine und Amidobetaine, Fettsäurealkanolamide, Polyglycol ther-Derivate.

Die oberflächenaktive Substanz kann in einer Konzentration zwischen 1 Gew.-% und 50 Gew.-% in dem Shampoonierungsmittel, bzw. der Wasch-, Dusch- oder Badezubereitung, vorliegen.

Liegt die kosmetische oder dermatologische Zubereitung in Form einer Lotion vor, die ausgespült und z.B. vor oder nach der Entfärbung, vor oder nach der Shampoonierung, zwischen zwei Shampoonierungsschritten, vor oder nach der Dauerwellbehandlung angewendet wird, so handelt es sich dabei z.B. um wäßrige oder wäßrig-alkoholische Lösungen, die gegebenenfalls oberflächenaktive Substanzen enthalten, bevorzugt nicht-ionische oder kationische oberflächenaktive Substanzen, deren Konzentration zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,2 und 5 Gew.-%, liegen kann. Diese kosmetische oder dermatologische Zubereitung kann auch ein Aerosol mit den üblicherweise dafür verwendeten Hilfsmitteln darstellen.

Eine kosmetische Zubereitung in Form einer Lotion, die nicht ausgespült wird, insbesondere eine Lotion zum Einlegen der Haare, eine Lotion, die beim Fönen der Haare verwendet wird, eine Frisier- und Behandlungslotion, stellt im allgemeinen eine wäßrige, alkoholische oder wäßrig-alkoholische Lösung dar und enthält mindestens ein kationisches, anionisches, nicht-ionisches oder amphoteres Polymer oder auch Gemische davon, sowie erfindungsgemäße Wirkstoffe. Die Menge der verwendeten erfindungsgemäßen Wirkstoffe liegt z.B. zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,1 und 3 Gew.-%.

Kosmetische und dermatologische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare, die die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe enthalten, können als Emulsionen vorliegen, die vom nicht-ionischen oder anionischen Typ sind. Nicht-ionische Emulsionen enthalten neben Wasser Öle oder Fettalkohole, die beispielsweise polyethoxyliert oder polypropoxyliert sein können, oder auch Gemische aus den beiden organischen Komponenten. Diese Emulsionen enthalten gegebenenfalls kationische oberflächenaktive Substanzen.

Kosmetische und dermatologische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare können als Gele vorliegen, die neben erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffen und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln noch organische Verdickungsmittel, z.B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

22

Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxy thylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z.B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist im Gel z.B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

Vorzugsweise beträgt die Menge der erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe in einem für die Haare bestimmten Mittel 0,01 Gew.-% bis 10 Gew.%, insbesondere 0,5 Gew.-% bis 5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, ohne sie einzuschränken.

PCT/EP96/05400

## Beispiel 1

# W/O-Crème

	1	II
Paraffinöl	10,00	10,00
Ozokerit	4,00	4,00
Vaseline	4,00	4,00
pflanzliches Öl	10,00	10,00
Wollwachsalkohol	2,00	2,00
Aluminiumstearat	0,40	0,40
Octylglucosid	3,00	-
Sucroselaurat	-	3,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q.:	s
Wasser, VES	ad 100,00	
pH:	ad 5,5 - 6,0	

## Beispiel 2

### O/W-Lotion

	l	II
Paraffinöl	5,00	5,00
Isopropylpalmitat	5,00	5,00
Cetylalkohol	2,00	2,00
Bienenwachs	2,00	2,00
Ceteareth-20	2,00	2,00
PEG-20-Glycerylstearat	1,50	1,50
Glycerin	3,00	3,00
Plantaren® 1200	5,00	-
Decylglucosid	-	5,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s	
Wasser, VES	ad 100,00	
pH:	ad 5,5 - 6,0	

PCT/EP96/05400

24

## Beispiel 3

## Hautöl

	1	11
Cetylpalmitat	3,00	3,00
C <sub>12-15</sub> - Alkylbenzoat	2,00	2,00
Polyisobuten	10,00	10,00
Squalan	2,00	2,00
Plantaren® 2000	5,00	-
Oramix®NS 10	-	5,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q	.s
Paraffinöl	ad 100,00	

# Beispiel 4

# Lippenstift

	1	11
Ceresin	8,00	8,00
Bienenwachs	4,00	4,00
Carnaubawachs	2,00	2,00
Vaseline	40,00	40,00
Hydriertes Rizinusöl	4,00	4,00
Caprylic/Capric Triglyceride	6,00	6, <b>0</b> 0
Plantaren® 1200	2,00	-
Sucrosemyristat	-	2,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s	
Paraffinöl	ad 100,00	

25

## Beispiel 5

## Pflegemaske

	I	II
PEG-50 Lanolin	0,50	0,50
Glycerylstearat	2,00	2,00
Sonnenblumenkernöl	3,00	3,00
Bentonit	8,00	8,00
Kaolin	35,00	35,00
Zinkoxid	5,00	5,00
Glucosecaprylat	2,00	•
Oramix® NS 10	•	2,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s	
Wasser, VES	ad 100,00	
pH:	ad 5,5 - 6,0	

## Beispiel 6

# Syndetseife

	1_	II
Natriumlaurylsulfat	30,00	30,00
Natriumsulfosuccinat	10,00	10,00
Kaliumcocoyl hydrolysiertes Kollagen	2,00	2,00
Dimethicon Copolyol	2,00	2,00
Paraffin	2,00	2,00
Maisstärke	10,00	10,00
Talcum	10,00	10,00
Glycerin	3,00	3,00
Plantaren® 1200	3,00	-
Oramix® NS 10	-	3,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s	
Wasser, VES	ad 100,00	
pH:	ad 5	,5 - 6,0

WO 97/22346 PCT/EP96/05400

26

# Beispiel 7

# Pflegeshampoo

	l _	II
Natriumlaurylsulfat	34,00	34,00
Dinatriumlaurylsulfosuccinat	6,00	6,00
Cocoamidopropylbetain	10,00	10,00
Glycoldistearat	5,00	5,00
Decylfructosid	2,50	-
Hexadecylglucosid	-	2,50
Parfum, Konservierungsstoffe	q	.s
Wasser, VES	ad 100,00	
pH:	ad 5,	5 - 6,0

### Beispiel 8

### Rasierschaum

	l	ll .
Stearinsäure	7,00	7,00
Natriumlaurylsulfat	3,00	3,00
Stearylalkohol	1,00	3,00
Glycerin	5,00	5,00
Triethanolamin	3,60	3,60
Sucrosecaprinat	1,50	-
Sucrosemyristat	-	1,50
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s	
Wasser, VES	ad 100,00	
pH:	ad 5,5 - 6,0	

27

## Beispiel 9

#### Aerosolspray

	1	ti
Octyldodecanol	0,50	0,50
Plantaren® 1200	2,00	-
Sucrosemyristat	-	2,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q.s	
Ethanol	ad 100,00	

Die durch Zusammennmischung der jeweiligen Bestandteile erhaltene flüssige Phase wird zusammen mit einem Propan-Butan-Gemisch (2:7) im Verhältnis 39:61 in Aerosolbehälter abgefüllt.

#### Beispiel 10

#### Roll-on-Gel

	I	<b>#</b> I
1,3-Butylenglycol	2,00	2,00
PEG-40-Hydriertes Rizinusöl	2,00	2,00
Hydroxyethylcellulose	0,50	0,50
Plantaren® 1200	5,00	-
Decylglucosid	-	5,00
Parfum, Konservierungsstoffe	q	.s
Wasser, VES	ad 100,00	
pH:	ad 5,5 - 6,0	

#### Patentansprüch:

WO 97/22346

- 1. Verwendung alkylierter und/oder acylierter Monosaccharide und/oder Oligosaccharide als antimikrobiell, antimykotisch und/oder antivirale Wirkstoffe.
- 2. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß als alkyliertes oder alkylierte und/oder acyliertes oder acylierte Monosaccharide Substanzen gewählt werden, welche durch die allgemeinen Strukturformeln

bzw.

wiedergegeben werden, wobei  $R_1$  und/oder  $R_2$  verzweigte oder unverzweigte gesättigte Alkylgruppen oder Acylgruppen mit 1 - 25 Kohlenstoffatomen umfassen.

3. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß als als alkyliertes oder alkylierte und/oder acyliertes oder acylierte Disaccharide bzw. -Oligoglycoside Substanzen gewählt werden, welche durch die allgemeinen Strukturformeln

HO-CH<sub>2</sub>—OH
HO OH
HO OH
$$R_3$$
 $R_4$ 
 $R_5$ 
 $R_4$ 
 $R_5$ 
 $R_5$ 
 $R_5$ 
 $R_6$ 
 $R_6$ 
 $R_6$ 
 $R_6$ 
 $R_7$ 
 $R_8$ 
 $R_7$ 
 $R_8$ 
 $R_8$ 
 $R_8$ 
 $R_9$ 
 $R_9$ 
 $R_9$ 
 $R_9$ 
 $R_9$ 
 $R_9$ 
 $R_9$ 

bzw.

29

bzw.

mit p = 1 - 4

bzw.

mit a = 1 - 4

wiedergegeben werden, wobei  $R_3$  -  $R_6$  verzweigte oder unverzweigte gesättigte Alkylgruppen oder Acylgruppen mit 1 - 25 Kohlenstoffatomen umfassen.

- 4. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die alkylierten und/oder acylierten Monosaccharide und/oder Oligosaccharide in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen vorliegen.
- 5. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das oder die alkylierten und/oder acylierten Monosaccharide und/oder Oligosaccharide gewählt werden aus der Gruppe  $\beta$ -D-Octylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Nonylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Decylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Dodecylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Tetradecylglucopyranosid,  $\beta$ -D-Hexadecylglucopyranosid.

- 6. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das oder die alkylierten und/oder acylierten Monosaccharide und/oder Oligosaccharide in natürlichen oder synthetischen Roh- oder Hilsfstoffen bzw. Gemischen vorliegen.
- 7. Verwendung nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, daß das oder die kosmetischen oder dermatologischen alkylierten und/oder acylierten Monosaccharide und/oder Oligosaccharide in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen eingesetzt werden in einem Gehalt von 0,005 50,0 Gew.-%, insbesondere 0,01 20,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.

#### WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internati nale Patentklassifikation 6:

A61K 31/70

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

WO 97/22346

**A3** 

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

26. Juni 1997 (26.06.97)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP96/05400

(22) Internationales Anmeldedatum: 4. December 1996 (04.12.96)

(30) Prioritätsdaten:

195 47 160.1

16. December 1995 (16.12.95) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BEIERS-DORF AG [DE/DE]; Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg (DE).

(72) Erfinder; und

- BÜNGER, Joachim (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): [DE/DE]; Niendorfer Kirchenweg 39b, D-22459 Hamburg (DE). SCHNEIDER, Günther [DE/DE]; Wrangelstrasse 65a, D-20253 Hamburg (DE). SCHREIBER, Jörg [DE/DE]; Erlenkamp 20, D-22087 Hamburg (DE). TEICHMANN, Stefan [DE/DE]; Giesestrasse 67, D-22607 Hamburg (DE). WOLF, Florian [DE/DE]; Husumer Strasse 2, D-20251 Hamburg (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: JP, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

#### Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchen-28. August 1997 (28.08.97) berichts:

(54) Title: USE OF SUGAR DERIVATIVES AS ANTIMICROBIAL, ANTIMYCOTIC AND/OR ANTIVIRAL ACTIVE SUBSTANCES

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON ZUCKERDERIVATEN ALS ANTIMIKROBIELL, ANTIMYKOTISCH UND/ODER AN-TIVIRALE WIRKSTOFFE

#### (57) Abstract

Use of alkylated and/or acylated monosaccharides and/ or oligosaccharides as antimicrobial, antimycotic and/or antiviral active substances.

#### (57) Zusammenfassung

Verwendung alkylierter und/oder acylierter Monosaccharide und/oder Oligosaccharide als antimikrobielle, antimykotische und/oder antivirale Wirkstoffe.

#### LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
ΑT	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
ΑÜ	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Neusceland
BF	Burkina Faso	IE	Irland	PL	Polen
BG	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
BJ	Benin	JP	Japan	RO	Rumānien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Копдо	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CH	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Мопасо	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dānemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauretanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	мw	Malawi	, . ,	

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT



Interia onal Application No

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 6 A61K31/70

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 6-A61K

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the ficids searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	J. AM. OIL CHEM. SOC., vol. 67, no. 12, 1990, pages 996-1001, XP000652676 SHUICHI MATSUMURA ET AL.: "Surface activities, biodegradability and antimicrobial properties of n-alkyl glucosides, mannosides and galactosides"	1,2,5
Y	see abstract see page 996	3,4,6,7
X	CHEM. PHARM. BULL., vol. 35, no. 7, 1987, pages 2894-2899, XP000652680 TETSURO IKEKAWA ET AL.: "Studies on synthesis of 3-0-alkyl-D-glucose and 3-0-alkyl-D-allose derivatives and their biological activities"	1
Υ	see abstract	2-7

X Further documents are listed in the continuation of box C.	Patent family members are listed in annex.
* Special categories of cited documents:  'A' document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  'E' earlier document but published on or after the international filing date  'L' document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  'O' document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means  'P' document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention  "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.  "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search  4 July 1997	Date of mailing of the international search report  21.07.97
Name and mailing address of the ISA  European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  NL - 2280 HV Rijswijk  Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+ 31-70) 340-3016	Authorized officer Tzschoppe, D

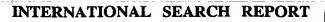
Form PCT/ISA/218 (second sheet) (July 1992)

2



Intermonal Application No PCT/EP 96/05400

(C	N DOCKINGDAM CONTRACTOR OF THE	PC1/EP 96/05400	
C.(Continua Category *	citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	
X	YUKAGAKU, vol. 40, no. 9, 1991, pages 709-714, XP000653016 SHUICHI MATSUMURA ET AL.: "Surface	1,5	
Υ	activities, foam suppression, biodegradability and antimicrobial properties of s-alkyl glucopyranosides" see abstract	2-4,6,7	
X	DATABASE WPI Section Ch, Week 9106 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class D22, AN 91-040092 XP002029142 & JP 02 306 906 A (KURITA WATER IND LTD), 20 December 1990	1,5	
Y	see abstract	2-4,6,7	
<b>X</b>	EP 0 144 894 A (BAYER AG) 19 June 1985 see page 11, paragraph 2 - page 13, paragraph 1; claim 1 see page 14, line 15 see page 15, paragraph 1	1,4-6	
Y	DATABASE WPI Section Ch, Week 9244 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 92-363075 XP002029143 & JP 04 266 827 A (SANYO CHEM IND LTD), 22 September 1992 see abstract	1-7	
Y	WO 93 02657 A (L'OREAL) 18 February 1993 see claims 1-6; examples 1-8	1-7	
Y	US 4 898 934 A (HARALD LUEDERS ET AL.) 6 February 1990 see column 1, paragraph 2	1-7	
Y	J. AM. OIL CHEM. SOC., vol. 47, 1970, pages 162-167, XP000652777 FRANCIS A. HUGHES ET AL.: "Physical and functional properties of some higher alkyl polyglucosides" see abstract; figure 1	1-7	
P,X	WO 96 23479 A (BEIERSDORF AG) 8 August 1996 see the whole document	1,4,6,7	
	-/		



Intenation No PCT/EP 96/05400

	PCT/EP 96/05400	
	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
x	DATABASE WPI Section Ch, Week 9327 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 93-216664 XP002034390 & JP 05 139 980 A (DAINIPPON INK & CHEM	1
Y	KK) , 8 June 1993 see abstract	2-7
X	PHYTOCHEMISTRY, vol. 25, no. 7, 1986, pages 1633-1636, XP000652010 Y.SHOYAMA ET AL.: "Four caffeoyl glycosides from callus tissue of Rehmannia Glutinosa"	1
Y	see page 1633, left-hand column, paragraph 2; table 2	2-7
X	US 5 220 008 A (SUBRAMANIAM SABESAN) 15 June 1993	1
Y	see column 3, line 45 - line 48; claim 1	2-7



International application No.

PCT/EP 96/05400

Box I	Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)
Thisinte	mational search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
1.	Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2.	Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3.	Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
Box II	Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)
This Inte	mational Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
	1. Claims 1-7: insofar as relating to the antimicrobial action.
	2. Claims 1-7: insofar as relating to the antimycotic action.  3. Claims 1-7: insofar as relating to the antiviral action.
1.	As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.	As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.	As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.	No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
Remark	on Protest  The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  No protest accompanied the payment of additional search fees.

### INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Inter. Lonal Application No PCT/EP 96/05400

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 144894 A	19-06-85 ø	DE 3344256 A JP 60139696 A US 4716152 A	20-06-85 24-07-85 29-12-87
WO 9302657 A	18-02-93	FR 2680103 A DE 69214299 D DE 69214299 T EP 0663812 A ES 2092695 T JP 7500578 T	12-02-93 07-11-96 20-02-97 26-07-95 01-12-96 19-01-95
US 4898934 A	06-02-90	DE 3729843 A CA 1306745 A EP 0306651 A JP 1071896 A	23-03-89 25-08-92 15-03-89 16-03-89
WO 9623479 A	08-08-96	DE 19503423 A	08-08-96
US 5220008 A	15-06-93	✓ US 5254676 A	19-10-93

**S** 

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT



Internationales Aktenzeichen PCT/EP 96/05400

# A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 6 A61K31/70

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

#### **B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 6

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS W	ESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN	
Kategone*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	J. AM. OIL CHEM. SOC., Bd. 67, Nr. 12, 1990, Seiten 996-1001, XP000652676 SHUICHI MATSUMURA ET AL.: "Surface activities, biodegradability and antimicrobial properties of n-alkyl glucosides, mannosides and galactosides"	1,2,5
Υ	siehe Zusammenfassung siehe Seite 996	3,4,6,7
X	CHEM. PHARM. BULL., Bd. 35, Nr. 7, 1987, Seiten 2894-2899, XP000652680 TETSURO IKEKAWA ET AL.: "Studies on synthesis of 3-0-alkyl-D-glucose and 3-0-alkyl-D-allose derivatives and their biological activities"	1
Υ	siehe Zusammenfassung	2-7

X	Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen
---	---

Siehe Anhang Patentfamilie

- Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen
- Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweiselhast erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbenicht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- ausgetuur)
  Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,
  eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
  Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach
  dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theone angegeben ist
- Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- ٠&٠ Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

21.07.97

4.Juli 1997

2

Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde Bevollmächtigter Bediensteter Europäisches Patentarnt, P.B. 5818 Patentlaan 2

NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo ni, Fax: (+31-70) 340-3016

Tzschoppe, D

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)





Inten. onales Aktenzeichen PCT/EP 96/05400

0.45	PCT/EP	30, 03+00
C.(Fortsetzi	mg) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN	
	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
х	YUKAGAKU, Bd. 40, Nr. 9, 1991, Seiten 709-714, XP000653016 SHUICHI MATSUMURA ET AL.: "Surface activities, foam suppression, biodegradability and antimicrobial	1,5
Υ	properties of s-alkyl glucopyranosides" siehe Zusammenfassung	2-4,6,7
X	DATABASE WPI Section Ch, Week 9106 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class D22, AN 91-040092 XP002029142 & JP 02 306 906 A (KURITA WATER IND LTD), 20.Dezember 1990	1,5
Y	siehe Zusammenfassung	2-4,6,7
X	EP 0 144 894 A (BAYER AG) 19.Juni 1985 siehe Seite 11, Absatz 2 - Seite 13, Absatz 1; Anspruch 1 siehe Seite 14, Zeile 15 siehe Seite 15, Absatz 1	1,4-6
Y	DATABASE WPI Section Ch, Week 9244 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 92-363075 XP002029143 & JP 04 266 827 A (SANYO CHEM IND LTD), 22.September 1992 siehe Zusammenfassung	1-7
Υ	WO 93 02657 A (L'OREAL) 18.Februar 1993 siehe Ansprüche 1-6; Beispiele 1-8	1-7
Υ	US 4 898 934 A (HARALD LUEDERS ET AL.) 6.Februar 1990 siehe Spalte 1, Absatz 2	1-7
Υ	J. AM. OIL CHEM. SOC., Bd. 47, 1970, Seiten 162-167, XP000652777 FRANCIS A. HUGHES ET AL.: "Physical and functional properties of some higher alkyl polyglucosides" siehe Zusammenfassung; Abbildung 1	1-7
P,X	WO 96 23479 A (BEIERSDORF AG) 8.August 1996 siehe das ganze Dokument	1,4,6,7
		1





Inten. Jonales Aktenzeichen
PCT/EP 96/05400

		CI/EP 9	06/05400
C.(Fortsetzi	ing) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommen-	den Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE WPI Section Ch, Week 9327 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B04, AN 93-216664 XP002034390 & JP 05 139 980 A (DAINIPPON INK & CHEM KK), 8.Juni 1993		1
Y	siehe Zusammenfassung		2-7
X	PHYTOCHEMISTRY, Bd. 25, Nr. 7, 1986, Seiten 1633-1636, XP000652010 Y.SHOYAMA ET AL.: "Four caffeoyl glycosides from callus tissue of Rehmannia Glutinosa"		1
Υ	siehe Seite 1633, linke Spalte, Absatz 2; Tabelle 2		2-7
Х	US 5 220 008 A (SUBRAMANIAM SABESAN)		1
Y	15.Juni 1993 siehe Spalte 3, Zeile 45 - Zeile 48; Anspruch 1		2-7

2



I -nationales Aktenzeichen

#### PCT/EP 96/05400

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT PCT/EP 96

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (F rtsetzung von Punkt 1 auf Blatt 1)
Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:
1. Ansprüche Nr. weil Sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. Ansprüche Nr. weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.
Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)
Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält
1) Ansprüche 1-7: insofern die antimikrobielle Wirksamkeit betroffen ist. 2) Ansprüche 1-7: insofern die antimykotische Wirksamkeit betroffen ist. 3) Ansprüche 1-7: insofern die antivirale Wirksamkeit betroffen ist.
1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche der internationalen Anmeldung.
2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Internationale Recherchenbehörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche der internationalen Anmeldung, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:
Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs  Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.  X Die Zahlung zusätzlicher Gebühren erfolgte ohne Widerspruch.



#### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Inten. onales Aktenzeichen PCT/EP 96/05400

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 144894 A	19-06-85	DE 3344256 A JP 60139696 A US 4716152 A	20-06-85 24-07-85 29-12-87
WO 9302657 A	18-02-93	FR 2680103 A DE 69214299 D DE 69214299 T EP 0663812 A ES 2092695 T JP 7500578 T	12-02-93 07-11-96 20-02-97 26-07-95 01-12-96 19-01-95
US 4898934 A	06-02-90	DE 3729843 A CA 1306745 A EP 0306651 A JP 1071896 A	23-03-89 25-08-92 15-03-89 16-03-89
WO 9623479 A	08-08-96	DE 19503423 A	08-08-96
US 5220008 A	15-06-93	US 5254676 A	19-10-93

; ;